



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyysw@sina.com

产品名称: **TM5441**
CAS 号: **1190221-43-2**
产品货号: **S87620**

生物活性:				
Description	TM5441 是一种口服生物可利用的纤溶酶原激活物抑制剂-1 抑制剂 (PAI-1), 抑制多个癌症细胞系的 IC50 值在 13.9 到 51.1 μ M, 并诱导几种人类癌症细胞的内在凋亡。TM5441 减弱 N ω -硝基-L-精氨酸甲酯诱导的心脏高血压和血管衰老。			
IC50 & Target	IC50: 13.9~51.1 μ M (Tumor cell lines)[1]			
In Vitro	TM5441 剂量依赖性地抑制 HT1080、HCT116、Daoy、MDA-MB-231 和 Jurkat 细胞, IC50 范围在 13.9 和 51.1 μM 之间[1]。 TM5441 以剂量依赖的方式增加 HT1080 和 HCT116 细胞的半胱天冬酶 3/7 活性。TM5441 增加 HT1080 和 HCT116 细胞的凋亡[1]。 TM5441 诱导线粒体去极化[1]。 在小鼠近端肾小管上皮细胞中, TM5441 有效抑制 PAI-1 诱导的纤维化和炎症标志物 mRNA 表达, 并逆转 PAI-1 诱导的纤溶酶活性抑制[2]。			
In Vivo	向 HT1080 和 HCT116 异种移植小鼠口服 TM5441 (每天 20 mg/kg) 会增加肿瘤细胞凋亡, 并对肿瘤血管系统产生显著破坏作用, 这与肿瘤生长减少和存活率增加有关。口服给药后 1 小时平均血浆浓度为 11.4 μM, 给药后 23 小时检测不到该水平[1]。 TM5441 减轻 Nω-硝基-L-精氨酸甲酯诱导的心脏高血压和血管衰老, 延长 klotho 缺失小鼠的寿命, 并在癌症中引发抗肿瘤发生和抗血管生成活性[3]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (233.20 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
	Preparing	1 mM	2.3320 mL	11.6599 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4664 mL	2.3320 mL
		10 mM	0.2332 mL	1.1660 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (5.83 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。				



	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (5.83 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Placencio VR, et al. Small Molecule Inhibitors of Plasminogen Activator Inhibitor-1 Elicit Anti-Tumorigenic and Anti-Angiogenic Activity. PLoS One. 2015 Jul 24;10(7):e0133786. [2]. Jeong BY, et al. Novel Plasminogen Activator Inhibitor-1 Inhibitors Prevent Diabetic Kidney Injury in a Mouse Model. PLoS One. 2016 Jun 3;11(6):e0157012.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3320 mL	11.6599 mL	23.3198 mL	58.2995 mL
	5 mM	0.4664 mL	2.3320 mL	4.6640 mL	11.6599 mL
	10 mM	0.2332 mL	1.1660 mL	2.3320 mL	5.8300 mL
	15 mM	0.1555 mL	0.7773 mL	1.5547 mL	3.8866 mL
	20 mM	0.1166 mL	0.5830 mL	1.1660 mL	2.9150 mL
	25 mM	0.0933 mL	0.4664 mL	0.9328 mL	2.3320 mL
	30 mM	0.0777 mL	0.3887 mL	0.7773 mL	1.9433 mL
	40 mM	0.0583 mL	0.2915 mL	0.5830 mL	1.4575 mL
	50 mM	0.0466 mL	0.2332 mL	0.4664 mL	1.1660 mL
	60 mM	0.0389 mL	0.1943 mL	0.3887 mL	0.9717 mL
	80 mM	0.0291 mL	0.1457 mL	0.2915 mL	0.7287 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	100 mM	0.0233 mL	0.1166 mL	0.2332 mL	0.5830 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶